化痰、止咳、平喘藥

化痰、止咳、平喘藥

- 祛痰，緩解或制止咳嗽、喘息為主要作用的藥物。
- 具有宣肺祛痰、止咳平喘功效。
- 主要用於痰多咳嗽、痰飲喘息及與痰飲有關的**癭瘤（甲狀腺腫大 ）瘰癧（頸部淋巴結腫大）**證。
- 性或溫、或寒，多入肺、心、脾、胃、大腸經。

痰飲

- 廣義：水液代謝障礙所形成的病理產物
  - 飲清澈停留於局部；痰稠濁在臟腑經絡
- 金匱要略：
  - 水走腸間，謂之**痰飲**；
  - 飲後水流在脅下，謂之**懸飲**；
  - 飲水流行歸於四肢，謂之**溢飲**；
  - 積於胸膈之間，謂之**支飲**。
- **肺**主宣降，通調水道，敷布津液，貯痰之器；
- **脾**主運化水液，生痰之源；
- **腎陽**主水液蒸化；
- 三焦為水液通行之道路。

痰飲

- 肺、脾、腎氣化失常→水濕停聚→痰飲
  - 肺→咳、喘、吐痰。
  - 心→胸悶、心悸、驚悸、神昏、譫妄癲狂。
  - 胃→噁心、嘔吐、胸悶。
  - 腸→腸鳴、下利、腹滿、食少。←痰飲
  - 經絡筋骨→瘰癧、痲木、半身不遂。
  - 肌膚→水腫←溢飲
  - 胸脅→胸脅脹滿、咳唾引痛。←懸飲
  - 膈上→咳喘，不能平臥。←支飲

痰證

- 概念：指水液凝聚而質稠，停於身體各部所引起的病證。
- 成因：
  - **陰虛火炎**，**上迫於肺**，肺氣熱則煎熬津液，凝結成痰；
  - **情志失調**，五志化火，津液受灼而痰凝；
  - 脾胃虛弱，或飲啖過度，致使**脾失健運**，水液壅滯成痰；
  - **腎虛水泛**，久而成痰；
  - **外感六淫**，使肺脾升降之機失常，水液內聚成痰。

- 臨床表現：咳喘胸悶，喉中痰鳴，咯痰，嘔吐痰涎，脘痞納呆，噁心，眩暈，神昏癲狂，肢體麻木，半身不遂，瘰　癭瘤，痰核乳癖，喉有異物感，舌苔白膩或黃膩，脈滑。

飲證

- 概念：指水飲質地清稀，停滯於胃腸、心肺、胸脅等處所致的證候。
- 成因：
  - 直接由外邪侵襲，影響臟腑對水液的氣化，以致水液停聚而產生；
  - 因中陽素虛，或複因飲食不慎、外邪內侵，以致水液轉輸、敷布發生障礙，從而停聚為病。

飲留胃腸證

- 概念：指寒飲留滯胃腸所表現的證候。金匱要略稱此為狹義之痰飲。
- 臨床表現：脘腹脹滿、胃中有振水聲、嘔吐清涎、腸間水聲漉漉、頭目眩暈、口淡不渴，舌苔白滑，脈沉滑。
- 辨證要點：本證多因飲食不節，恣飲無度，或勞倦內傷，脾胃受損，中陽不振，脾失健運，水停為飲，留滯胃腸而成。
- 審證要點：胃腸有水聲，脘腹脹滿。

飲停於肺證

- 概念：指寒飲壅阻於肺，肺失肅降所表現的證候。金匱要略稱此為支飲。屬內科肺脹病。本證多因脾腎陽虛，伏飲內停，遇寒則發，纏綿難愈。
- 臨床表現：咳喘上逆，胸悶短氣，倚息不得平臥，喉中痰鳴，痰多清稀如水或呈泡沫狀，甚則心悸浮腫，舌淡苔白滑，脈弦或緊。
- 辨證要點：喘咳、吐清稀泡沫痰。

飲停胸脅證

- 概念：指水飲停於胸脅，氣機受阻，表現為胸脅飽脹，咳唾引痛為主症的證候，又稱為"懸飲"。本證多因中陽素虛，氣不化水，水停為飲，或因外邪侵襲，肺失通調，水液營運輸布障礙，停聚為飲，流注脅間而成。
- 臨床表現：胸脅脹悶疼痛，咳唾痛甚，肋間飽滿，氣息短促，或眩暈，身體轉側或呼吸時胸脅部牽引作痛，舌苔白滑，脈沉弦。
- 審證要點：胸脅脹悶疼痛、咳唾引痛。

- 中醫對痰的認識：
  - 廣義的痰
    - 指停積於臟腑經絡之間各種各樣的痰證，
    - 如痰濁滯於皮膚經絡可生瘰癧癭瘤，
    - 常見於現代醫學中的皮下腫塊、**慢性淋巴結炎**、單純性**甲狀腺腫**疾病。
    - 痰痺阻**胸**，則胸痛、胸悶、心悸，見於**冠心病**、**心絞痛**、**高血壓**、**心力衰竭**。
    - 痰迷**心竅**，則心神不寧，昏迷、譫妄、精神錯亂，見於**腦血管意外**、**癲癇**、**精神分裂症**。

- 中醫對痰的認識：
  - 狹義的痰：
    - 指**呼吸道咳出的痰**，多見於上呼吸道感染、急慢性支氣管炎、肺氣腫、支氣管擴張肺部疾患。
- 一般**咳嗽有痰**者為多，痰多又易引起**咳喘**。
  - 痰、咳、喘三者關係密切，互為因果。

- 祛痰藥多能止咳，
- 止咳、平喘藥又多兼有化痰作用。
  - 功效與相應的選擇性藥理作用難以明確區分。

祛痰作用

- **桔梗、川貝母、前胡、紫菀、皂莢、天南星、款冬花、蔊菜、滿山紅**的煎劑或流浸膏均有祛痰作用，都能**增加呼吸道的分泌量**，一般在給藥1小時後作用達到高峰，其中以**桔梗、前胡、皂莢**作用最強，而款冬花較弱。
- 家兔口服**天南星**煎劑後，增加呼吸道分泌的作用可持續4小時以上。
- 以上藥物除**蔊菜含蔊菜素**，滿山紅含**杜鵑素**外，其餘藥物的祛痰作用多與所含**皂苷**有關。

- **皂苷**能**刺激胃**或**咽喉黏膜**，反射性地引起輕度噁心，增加支氣管腺體的分泌，從而**稀釋痰液**而發揮祛痰作用。
- **杜鵑素祛痰**作用：
  - **促進氣管黏液分泌，纖毛運動，增強呼吸道清除異物**的功能，
  - **溶解黏痰**，使呼吸道分泌物中**酸性黏多糖纖維**斷裂，同時**降低唾液酸的含量**，使痰液黏稠度下降，易於咯出。

止咳作用

- **半夏、苦杏仁、桔梗、款冬花、貝母、百部、滿山紅、紫菀**均有程度不的鎮咳作用。
- 半夏、苦杏仁、百部的鎮咳作用部位可能在中樞神經系統。

平喘作用

- 浙貝母、葶菜、苦杏仁、款冬花、批把葉有一定的**擴張支氣管**作用。
- 中藥的**平喘作用機理**是多方面的：
  - **浙貝鹼**能**擴張**家兔、貓**支氣管平滑肌**，**直接抑制支氣管痙攣**以緩解哮喘症狀。
  - **款冬花醚提物**：可能與興奮神經節有關。
  - **桔梗皂苷**、**款冬花醚提物**能抑制**組織胺**所致豚鼠支氣管痙攣，其作用可能與**抗過敏**有關。

化痰、止咳、平喘藥主要藥理作用

藥 物	祛痰	止咳	平喘	其他作用
半 夏	＋	＋		鎮吐，抗腫瘤，抗早孕，抗心律失常，抗潰瘍，降血脂
桔 梗	＋	＋		抗發炎，抗潰瘍，解熱，鎮靜，鎮痛，降血糖，降血脂
川貝母	＋	＋		抑菌，鬆弛胃腸肌，抗潰瘍，升高血糖，降血壓
浙貝母	＋	＋	＋	興奮子宮，收縮腸肌，降血壓，鎮靜，鎮痛
苦杏仁	＋	＋	＋	抗發炎，鎮痛，抗腫瘤，抑制胃蛋白 活性，促進免疫
款冬花	＋	＋	＋	升壓，抑制血小板聚集
紫 苑	＋	＋		抗菌，抗病毒，抗腫瘤
前 胡	＋			抗發炎，抗過敏，抗心律失常，擴張血管，抗血小板聚集
蔊 菜	＋	＋	＋	抗菌
天南星	＋			鎮靜，鎮痛，抗驚膠，抗腫瘤

桔梗

- 桔梗科植物桔梗Platycodon grandiflorum (Jacq) A. DC 的乾燥根。
- 主要成分：
  - 皂苷： 迄今已分得18種，主要為桔梗皂苷 (platycodin)。
    - 苷元為三萜酸的混合物： 有桔梗皂苷元 (platycodigenin)，遠志酸 (platycogenic acid)，桔梗酸A、B、C(platycogenic acid A、B、C)，
  - 桔梗聚糖 (platycodonin)、白樺脂醇 (betulin)、α-菠菜甾醇 α-spinasterol)、α-菠菜甾醇-β-D一葡萄糖甘(α-spinasteryl-β-D-glycoside) 、 多種氨基酸和微量元素。
- 味苦、辛，性平。歸肺經。

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：宣肺、利咽、祛痰、排膿。
- 主治：咳嗽痰多，咽喉腫痛，音啞，肺癰吐膿，胸滿脅痛，瘡瘍膿腫。
- 珍珠囊：其用有四：止咽痛，兼除鼻塞;利膈氣，乃治肺癰;一為諸藥之舟楫;一為肺部之引經。
- 本草匯言：主利肺氣，通咽喉，寬中理氣，開鬱行痰之要藥也。

祛痰與鎮咳

- 麻醉犬灌服桔梗煎劑1g/kg後，能顯著**增加呼吸道黏液的分泌量**，其強度與氯化銨(Ammonium Chloride)相似。
- 對麻醉貓有明顯的**祛痰作用**，可持續7小時以上。
- 桔梗的根、根皮、莖、葉、花、果均有顯著的祛痰作用。
- 豚鼠多次灌服粗製桔梗皂苷80mg/kg：祛痰效果。
- 桔梗的祛痰作用主要是其所含的皂苷經口服刺激胃黏膜，反射性地增加支氣管黏膜分泌，使痰液稀釋而被排出。

祛痰與鎮咳

- 桔梗水提物750mg/kg腹腔注射，對**機械刺激豚鼠氣管黏膜**引起的咳嗽，鎮咳效果達60%。
- 桔梗皂苷亦有**鎮咳作用**，其鎮咳ED_{50}為6.4mg/kg，大約是LD_{50}的1/4。
- 野生桔梗與二年栽培品的祛痰、鎮咳作用無明顯差別。

抗發炎

- 桔梗皂苷：
  - 灌胃對**角叉菜膠**及**醋酸**所致的大鼠足腫脹，有較強的抗發炎作用。
  - 每日給大鼠灌胃50 mg/kg、100 mg/kg，連續7日，對**棉球肉芽腫**有顯著抑制作用，對大鼠**佐劑性關節炎**也有效。
  - 明顯抑制**過敏性休克**小鼠毛細血管通透性。

抗發炎

- 桔梗水提物：
  - 可**增強巨噬細胞的吞噬功能**，增強中性白血球的**殺菌力**，提升**溶菌酶**的活性。
  - 對小鼠腹腔巨噬細胞**NO的釋放**有調節作用，可能是其抗發炎作用的機理之一。
    - NO可由巨噬細胞產生，在炎症中有多向性的作用，一方面能**擴張血管**，另一方面又可**抑制血小板、肥大細胞、白血球介導的炎症反應**。

降血糖和降血脂

- 桔梗水或乙醇提取物：
  - 對正常和四氧嘧啶(alloxan)性糖尿病家兔，均可使血糖下降，降低的肝糖原在用藥後恢復，
  - 能抑制食物性血糖升高，
  - 醇提取物的作用較水提取物強。
- 桔梗皂苷：
  - 可降低大鼠肝內膽固醇的含量，
  - 增加膽固醇和膽酸的排泄。

鎮靜、鎮痛、解熱

- 桔梗皂苷：
  - 小鼠灌胃能**抑制小鼠自發活動**，
  - 延長環己巴比妥鈉的睡眠時間，呈明顯的鎮靜作用;
  - 對小鼠醋酸性扭體反應及尾壓法呈鎮痛作用;
  - 對正常小鼠及傷寒、副傷寒疫苗所致的發熱小鼠，均有顯著的解熱作用。

擴張血管、減慢心率

- 桔梗皂苷：
  - 麻醉犬動脈內注射100-400 μg，能顯著降低後肢血管和冠狀動脈的阻力，增加血流量，其擴張血管作用優於罌粟鹼。
  - 靜脈注射4mg/kg時，可增加冠脈和後肢血管血流量，並伴有暫時性低血壓。
  - 大鼠靜脈注射0.5~5mg/kg，可見暫時性血壓下降、心率減慢和呼吸抑制，隨著劑量增大，持續時間延長。
  - 對離體豚鼠心房可使收縮力減弱，心率減慢，但能對抗ACh引起的心房抑制。

抗潰瘍

- 桔梗皂苷：
  - 能抑制大鼠胃液分泌和抗消化性潰瘍作用。
  - 100 mg/kg幾乎能完全抑制大鼠幽門結扎所致的胃液分泌。
  - 大鼠十二指腸注入25mg/kg，可防止大鼠消化性潰瘍的形成，與皮下注射10 mg/kg atropine作用相當。
  - 對大鼠醋酸所致的慢性潰瘍有明顯療效，每日25 mg/kg組的療效比甘草提取物FM_{100}每日200 mg/kg組為高。

綜述

- 宣肺、利咽、祛痰、排膿功效：
  - 與祛痰、鎮咳、抗發炎藥理作用相關。
- 主要活性成分：**桔梗皂苷**。
- 現代研究：桔梗及桔梗皂苷的降血糖、降血脂、鎮靜、鎮痛、解熱、擴張血管、減慢心率、抗潰瘍作用。

現代應用

1. 肺炎：桔梗15g，魚腥草36g，煎成200 mL，1次服30ml，每日3-4次。
2. 急性扁桃體炎：桔梗10g，生地30g，麥冬12g，甘草5g，水煎服，每日1劑。
3. 聲帶小結：生炒桔梗、生煨訶子各58g，生炙甘草2g，生熟地6g，水煎服，每日1劑。

不良反應

- 小鼠灌服**桔梗煎劑**的LD50為24g/kg。
- 兔灌服煎劑40g/kg，於24小時內5只全部死亡，當劑量為20g/kg時，全部存活。
- **桔梗皂苷**的LD50：
  - 小鼠、大鼠灌胃分別為420mg/kg和大於800mg/kg，腹腔注射分別為22.3mg/kg和14.1mg/kg。
  - 豚鼠腹腔注射為23.1mg/kg。
- 桔梗口服一般無毒副反應，偶見噁心、嘔吐，重者可見四肢出汗、乏力、心煩。
- **桔梗皂苷**有很強的**溶血作用**，故不能注射給藥。

半夏

- 天南星科植物半夏Pinella ternata (Thunb) Breit.的乾燥塊莖。
- 主要成分:
  - 揮發油，β-谷甾醇 (β-sitosterol)、膽鹼 (Choline)、胡蘿蔔苷 (daucosterol)、葡萄糖醛酸苷 (glucuronide)、黑尿酸 (homogentisic acid)、甲硫氨酸、2，4-二羥基苯甲醛葡萄糖甘、左旋麻黃鹼 (l-ephedrine)、胡蘆巴鹼 (trigonelline)、天門冬氨酸 (aspartic acid)、β-氨基丁酸和γ-氨基丁酸 (β-aminobutyric acid和γ-aminobutyric acid)多種氨基酸
  - 少量脂肪、多糖、澱粉、蛋白質。
- 味辛，性溫，有毒。歸脾、胃、肺經。

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：燥濕化痰，降逆止嘔，消痞散結。
- 主治：痰多咳喘，痰飲眩悸，風痰眩暈，痰厥頭痛，嘔吐反胃，胸脘痞悶，梅核氣;
- 生用外治癰腫痰核。
- 醫學啟源：治寒痰飲冷傷肺而咳。
- 外台秘要：燥胃濕，化痰，消腫散結。

鎮咳

- 生半夏、薑半夏、明礬(清)半夏的煎劑灌胃0.6-1.0 g/kg，對電刺激貓喉上神經或胸腔注入**碘液**所致的咳嗽有明顯的鎮咳作用。給藥後30分鐘起效，可維持5小時以上。
  - 0.6g/kg的鎮咳作用較1 mg/kg的codeine弱，
  - 鎮咳部位認為在**咳嗽中樞**，
  - 鎮咳成分為**生物鹼**。

鎮吐和催吐

- 半夏加熱或加明礬、薑汁炮製的各種製品，對apomorphine、洋地黃、硫酸銅引起的嘔吐，都有一定的鎮吐作用。
  - 鎮吐機理可能為**抑制嘔吐中樞**。
  - 鎮吐成分：生物鹼、甲硫氨酸、甘氨酸、葡萄糖醛酸或L-麻黃鹼。
- 動物實驗：生半夏有催吐作用，半夏粉在**120°C**焙2-3小時，即可**除去催吐成分**，而不影響其鎮吐作用。
  - 說明半夏催吐和鎮吐分別屬於兩種不同成分所致。

- 眼結膜刺激試驗：
  - 生半夏混懸液具有顯著的**黏膜刺激作用**，經**炮製**後其刺激性明顯降低。
  - 催吐與所含**2，4-二羥基苯甲醛葡萄糖苷**有關，因其苷元有強烈的黏膜刺激作用。

對消化系統的影響

- 半夏能顯著**抑制胃液分泌**，**抑制胃液酸度**，**降低游離酸和總酸酸度及抑制胃蛋白酶活性**，對急性胃黏膜損傷有保護和促進恢復作用。
- 薑礬半夏和薑煮半夏2g/kg灌胃，對大鼠胃蛋白酶活性及胃液中PGE2的含量無明顯影響，
- **生半夏**能明顯**降低大鼠胃酸和胃蛋白酶 的活性**，顯著**減少胃液中PGE2的含量**，對胃黏膜損傷較大。
  - 胃黏膜細胞分泌的**PGE2**是一種內源性的**胃黏膜保護介質**，
  - 推測生半夏對胃腸道的損傷作用可能與其抑制胃腸黏膜內的PGE2分泌有關。

- 半夏：
  - 能顯著**增強家兔腸道輸送能力**。
  - 對豚鼠離體腸管的收縮作用，**不被河豚毒素所抑制**，而能為**阿托品所抑制**，
    - 提示作用於**乙醯膽鹼受體**而產生收縮作用。
  - 能抑制**乙醯膽鹼**、**組織胺**、**氯化鋇**所引起的腸道收縮。

- 對鶺鴒回腸鬆弛作用及抗組織胺作用的成分是麻黃鹼。
- 薑礬半夏和薑煮半夏2g/kg灌胃，對小鼠胃腸運動呈明顯抑制作用，
- 生半夏2g/kg灌胃，對小鼠胃腸運動則呈顯著促進作用。
- 半夏醇提物對小鼠實驗性胃潰瘍有明顯的抑制作用，並有一定的止痛、抗發炎作用。

抗腫瘤

- **半夏多糖**成分具有使**多形核白血球活化作用**和**抗腫瘤**作用。
- 體外培養**腫瘤細胞**實驗：
  - 半夏各炮製品總生物鹼對**慢性髓性白血病細胞**(K652)的生長均有**抑制作用**。
  - 薑浸半夏、薑煮半夏、礬半夏、薑礬半夏的總生物鹼的IC50皆小於100μg/mL，
  - 以**礬半夏**抗K652腫瘤細胞生長作用最強，薑製半夏次之，薑製半夏甲醇提取物亦有明顯對抗作用。

抗腫瘤

- **胡蘆巴鹼**--其所含的一種季銨生物鹼，對小鼠肝癌有抑制作用。
- 從半夏的新鮮鱗莖中分離的**外源性凝聚素(PTA**，低分子蛋白)
  - **可凝集多種癌細胞**，對於**鑑別乳房上皮細胞**是否惡性瘤化是一種很好的指示劑。
  - 還可**凝集人肝癌細胞、艾氏腹水癌細胞及腹水型肝癌細胞**。

其他藥理作用

抗生育和抗早孕

- **半夏蛋白**：
  - 30 mg/kg皮下注射，對小鼠有明顯的抗早孕作用。
  - **可抑制卵巢黃體孕酮的分泌**，使血漿孕酮濃度明顯下降，子宮內膜變薄，使蛻膜反應逐漸消失，胚胎失去蛻膜支持而流產。
  - 子宮內注射500μg，抗免胚胎著床，
    - 機理：可能是半夏蛋白結合在子宮內膜腺管的上皮細胞膜上，改變了細胞膜功能所致。

抗心律失常

- 半夏水浸劑0.2-0.3g/kg，
  - 靜脈注射能使**氯化鋇**所致**犬室性早搏**迅速消失，且未復發;
  - 能使**腎上腺素**所致**心搏過速**轉為竇性心律。
  - 靜脈注射**半夏浸劑**至室性早搏完全消失的時間為30.10秒。
- 用柱層析分離法得到的半夏提取物0.56~0.88mg/kg醇溶劑，靜脈注射對氯化鋇引起的犬室性心律失常有明顯的對抗作用。
- **半夏水煎醇沉液**可增加離體兔心的冠脈流量。

對實驗性矽沈著病的影響

- **薑半夏製劑**腹腔注射或肌內注射，對大鼠實驗性矽沈著病的發展有**抑制作用**，
  - 肺乾重或濕重降低，
  - 全肺膠原蛋白量減少，病理改變較輕。
  - 預防給藥效果最好，發病後給藥亦有一定療效，
  - 但肺組織中的SiO_2含量無明顯變化。

降血脂

- 半夏4.02g/kg灌降胃：
  - 可阻止或延緩食餌性高脂血症的形成，
  - 對高脂血症有一定的治療作用，
  - 明顯降低TC和LDL-C。

- 半夏能顯著抑制小鼠的自主活動，與乾薑同用對中樞的抑制作用比單用半夏強。
- 半夏中的葡萄糖醛酸衍生物對strychninie和乙醯膽鹼有解毒作用。
- 半夏蛋白對運動神經末梢膜電流作用的總合效應為促進Ca^{2+}內流，提高細胞內Ca^{2+}濃度，從而增強神經遞質釋放。
- 半夏煎劑給兔灌胃，可輕度降低兔的眼內壓。
- 半夏水浸液有抗皮膚真菌的作用。
- 半夏具有糖皮質激素樣作用，5mg/kg以上用量的半夏，可使血中皮質酮含量上升，20mg/kg時為正常水準的2.5倍。

綜述

- 燥濕化痰、降逆止嘔、消痞散結功效：
  - 與鎮咳、鎮吐、抗腫瘤作用有關。
- 主要活性成分：生物鹼、甲硫氨酸、甘氨酸、葡萄糖醛酸、多糖、蛋白。
- 半夏尚有抗生育、抗早孕、抗心律失常及降血脂作用。

現代應用

1. 妊娠嘔吐：配伍山藥，治療重症妊娠嘔吐。
2. 慢性咽炎：炙半夏 (砸碎)，治療慢性咽炎。
3. 突發性音啞：用炙半夏治療咽部充血水腫突發性失音患者。
4. 甲狀腺腫瘤：生半夏，水煎15分鐘以上，隔日或2-3日1劑連服20劑，治療甲狀腺腫瘤。
5. 子宮頸糜爛：生半夏洗淨曬乾研粉，外用。

6. 牙痛：生半夏30g，搗碎，置90%酒精棉球90 mL中，浸1日即可用。用時以棉球蘸藥液塞入齲齒洞中，或塗擦病牙周遭。

7. 尋常疣及趾疣：鮮半夏 (洗淨去皮)，在疣體局部塗擦1-2分鐘，日3-4次，治療15-30日。

不良反應

- 生半夏對口腔、喉頭和消化道黏膜有強烈刺激性，人誤服後會發生腫脹、疼痛、失音、流涎、痙攣、呼吸困難，甚至窒息而死。炮製後毒性降低。
- 半夏的毒性成分為不耐熱、難溶於水的黏液質、黑尿酸及生物鹼。因此生半夏必須煎服。
- 生半夏粉9 g/kg灌胃，對妊娠雌性大鼠和胚胎均有非常顯著的毒性。
- 製半夏湯劑30g/kg(相當於臨床常用量的150倍)則能引起孕鼠陰道出血，胚胎早期死亡數增加，胎兒體重顯著降低。

- 生半夏粉末混懸液小鼠腹腔注射的LD50為0.55 g/kg，薑製半夏LD50為1.23g/kg。
- 生半夏和薑半夏注射劑分別給小鼠腹腔注射10 g(生藥)/kg，連續用藥10日，採用骨髓細胞染色體分析技術：
  - 二種半夏注射劑誘發致突變頻率明顯高於空白組，與致突變劑mitomycin C相近，
  - 提示兩種製劑對小鼠遺傳物質具有損害作用。

川貝母

- 百合科植物：
  - 川貝母Fritillaria cirrhosis D.Don、
  - 暗紫貝母 Fritillaria unibracteata Hsiao et K.C.Hsia、
  - 甘肅貝母Fritillaria przewalskii Maxim.
  - 棱砂貝母Fritillaria delavayi Franch.的乾燥鱗莖。

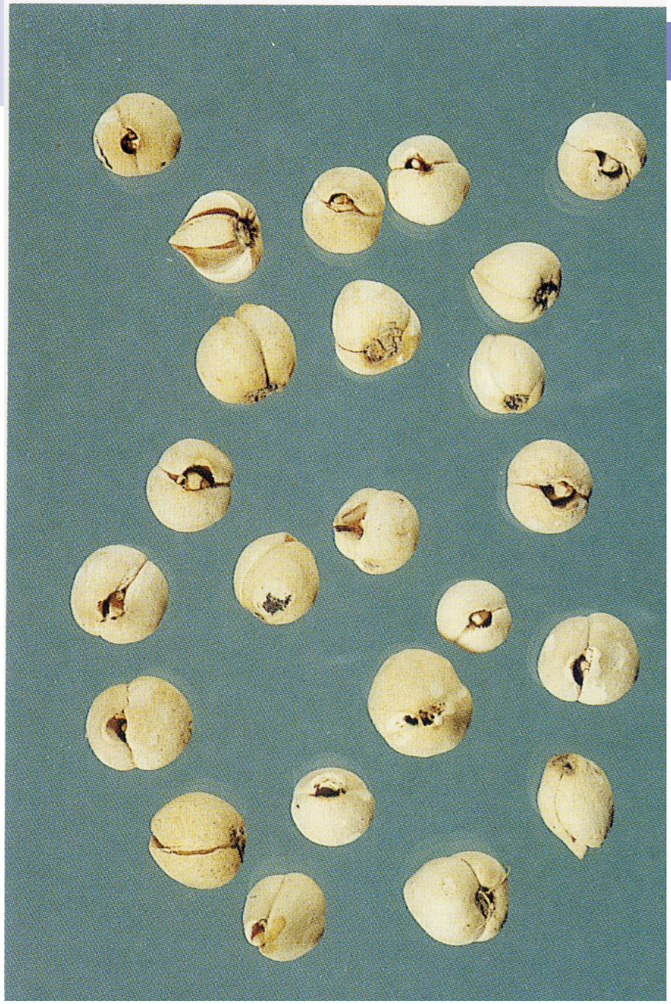
川貝母

- 主要成分:
  - 生物鹼：
    - 川貝母:
      - 青貝鹼 (Chinpeimine)，
      - 松貝鹼甲、乙 (sonpeimine A、B)，
      - 川貝母鹼 (Fritimine)
      - 西貝素 (Sipemine)。

川貝母

甘肅貝母

暗紫貝母



青貝

松貝

黃爐貝

白爐貝

川貝母主要成分

- 暗紫貝母：蔗糖，松貝寧(songbeisine)。
- 甘肅貝母：岷貝鹼甲、乙。
- 棱砂貝母：
  - 西貝母鹼、
  - 棱砂貝母鹼、棱砂貝母酮鹼、
  - 月隕酮鹼、
  - 棱砂貝母芬酮鹼。
  - 皂苷。
- 味苦、甘，性微寒。歸肺、心經。

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：清熱潤肺，化痰止咳，散結消腫。
- 主治：肺熱燥咳，乾咳少痰，陰虛勞嗽，咯痰帶血，肺癰，瘰癧，癰腫，乳癰。
- 本草匯言：貝母，開鬱、下氣、化痰之藥也，潤肺清痰，止咳定喘，則虛勞火結之症，貝母專司首劑。

鎮咳祛痰

- 川貝母流浸膏小鼠灌胃，對氨水刺激引起的咳嗽無明顯鎮咳作用，但能使小鼠呼吸道酚紅分泌量增加，有明顯祛痰作用。
- 組織培養的川貝和野生川貝 (寧貝母、平貝母)：
  - 均有顯著的鎮咳作用，作用可持續3小時。
  - 小鼠酚紅排泌法試驗顯示，均有祛痰作用，給藥60分鐘後為作用峰值，2小時後作用下降。
- 川貝母生物鹼小鼠灌胃，對二氧化硫刺激引起的咳嗽無明顯鎮咳作用，而酚紅排泌法祛痰試驗證明有顯著的祛痰作用。

- 大鼠灌胃川貝醇提取物或川貝總苷，經毛細管法祛痰試驗證明均有祛痰作用。
- 貓腹腔注射川貝醇提物4g(生藥)/kg，對電刺激喉上神經引起的咳嗽有非常顯著的鎮咳作用;靜脈注射川貝總鹼5mg/kg也有顯著鎮咳作用。
- 以上結果顯示，川貝母祛痰作用非常顯著。

平喘

- 湖北貝母醇提取物和總生物鹼，對由組織胺所致的豚鼠離體平滑肌痙攣有明顯鬆弛作用。
- 總生物鹼25mg/kg腹腔注射，對由乙醯膽鹼和組織胺引喘的豚鼠有顯著平喘效果。

抑菌

- 體外抗菌試驗表明，川貝水浸液能抑制星形奴卡菌生長;
- 川貝醇提取物2g(生藥)/ml對金黃色葡萄球菌和大腸桿菌有明顯抑菌作用。

其他藥理作用

對胃腸道作用

- 西貝母鹼：
  - 對離體豚鼠回腸、兔十二指腸及在體大小腸有鬆弛作用;
  - 能對抗乙醯膽鹼、組織胺和氯化鋇所致的痙攣，作用與罌粟鹼相似。
- 湖北貝母醇提物和總鹼對離體豚鼠回腸有鬆弛作用，
- 平貝母總鹼皮下注射或腹腔注射15mg/kg或30mg/kg：
  - 對大鼠結紮幽門性潰瘍、indomethacin型潰瘍及應激性潰瘍都有抑制作用，
  - 作用機理可能與其抑制胃蛋白酶活性有關。

對心血管作用

- 貓靜脈注射川貝母鹼4.2mg/kg可引起血壓下降，並伴有短暫的呼吸抑制。
- 犬靜脈注射西貝母鹼可引起外周血管擴張，血壓下降，此時心電圖無變化。
- 貓靜脈注射湖北貝母總鹼30 mg/隻，有短時中度降血壓作用，並伴有心率減慢。
- 湖北貝母醇提取物和總鹼，對離體兔耳血管有擴張作用。
- 平貝母水溶成分對PAF誘導血小板聚集有抑制作用，其主要有效成分為腺苷（adenosine）。

- 川貝母鹼7.5mg/kg兔靜脈注射，可使血糖增高，並維持2小時以上。
- 川貝母和湖北貝母醇提取物5g(生藥)/kg灌胃，能明顯提升小鼠耐缺氧的能力。
- 湖北貝母總鹼50 mg/ml兔滴眼有明顯擴瞳作用。

綜述

- 川貝母：
  - 清熱潤肺，化痰止咳，散結消腫之功效：鎮咳祛痰、平喘、抑菌作用。
  - 主要成分：川貝母中的生物鹼。
- 現代研究：川貝母及川貝母生物鹼對胃腸道、心血管的作用。

現代應用

1. 急慢性支氣管炎及上呼吸道感染引起的咳嗽，咳痰不利。
2. 肺結核咳嗽。

不良反應

- 小鼠靜脈注射川貝母鹼的最小致死量為40mg/kg，兔為12~15mg/kg。
- 大鼠靜脈注射西貝母鹼的LD50為148.4mg/kg。
- 小鼠腹腔注射湖北貝母醇提物的LD50為13.7g(生藥)/kg，
- 川貝醇提取物的LD50>50g(生藥)/kg。
- 小鼠皮下注射平貝母總鹼3mg/kg，每日1次，連續3周，小鼠的血象、肝功能、腎功能、心、肝、脾、肺、腎均無異常。

浙貝母

- 百合科多年生草本植物浙貝母Fritillaria thunbergii Miq的乾燥鱗莖。
- 主要成分:
  - 生物鹼:
    - 浙貝母鹼 (Verticine)、
    - 去氫浙貝母鹼 (Verticinone)、
    - 異浙貝母鹼 (iso-verticine)、
    - 膽鹼(choline) ，

浙貝母

- 浙貝母苷 (peiminoside)、
- 貝母醇 (ppropeimine)、
- 胡蘿蔔素(carotene)
- 多種二萜類化合物、脂肪酸。

■ 味苦，性寒。歸肺、心經。

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：清熱化痰，降氣止咳，散結消腫。
- 主治：風熱或痰熱咳嗽，肺癰吐膿，瘰癧癭瘤，瘡癰腫毒。
- 本草綱目拾遺：
  - 解毒利痰，開宣肺氣，凡肺家夾風火有痰者宜此。
  - 大治肺癰、肺痿、咳喘……最降痰氣。

祛痰、鎮咳

- **浙貝醇提物**可使大鼠呼吸道分泌液增加，有祛痰作用。
- **浙貝母鹼**腹腔注射，對二氧化硫引咳小鼠有鎮咳作用。
- **浙貝母鹼和去氫浙貝母鹼**，皮下注射或灌胃，對**氫氧化銨**引咳小鼠和**機械刺激**引咳豚鼠及電刺激喉上神經引咳貓，均有顯著鎮咳作用，而皮下注射對二氧化硫引咳豚鼠無明顯鎮咳作用。
- 浙貝母水煎劑，對碘溶液注入肋膜腔引咳貓無鎮咳作用。

平喘

- 浙貝母鹼1:1,000,000對貓和兔離體肺灌流，每分鐘可增加流出量50%以上，而1:100,000則流出量減少20%，說明低濃度對支氣管平滑肌表現擴張，高濃度則收縮。
- 浙貝醇提物對組織胺引起的豚鼠離體氣管片收縮有明顯鬆弛作用。

抗發炎

- 浙貝母：
  - 抗二甲苯性小鼠耳腫脹
  - 抑制角叉菜膠引起的小鼠足蹠腫脹作用，
  - 降低醋酸性小鼠腹腔毛細血管通透性。

其他藥理作用

鎮靜、鎮痛

- 浙貝母鹼和去氫浙貝母鹼：
  - 2mg/kg，皮下注射可使小鼠自發活動明顯減少;
  - 4mg/kg灌胃，可使戊巴比妥鈉引起的小鼠睡眠率提升，睡眠時間延長;
  - 皮下注射1mg/kg可抑制小鼠醋酸所致扭體反應。
- 浙貝母醇提物抑制：
  - 醋酸所致的小鼠扭體反應。
  - 熱痛刺激引起的甩尾反應。

對平滑肌的作用

- 貝母鹼1:10000濃度可使免離體小腸和子宮收縮加強，已孕子宮比未孕子宮敏感，阿托品不能消除其對子宮的收縮作用。
- 浙貝醇對乙醯膽鹼引起的豚鼠回腸收縮有明顯鬆弛作用。

抗潰瘍、止瀉

- 淅貝母醇提物 (相當生藥2.4g/kg)：
  - 抑制水浸應激性和鹽酸性小鼠胃潰瘍形成，
  - 對indomethacin、乙醇性小鼠潰瘍模型的抗潰瘍作用不明顯;
  - 能強而持久的抗蓖麻油和番瀉葉引起的小鼠腹瀉。

對心血管的作用

- 浙貝母鹼和去氫浙貝母鹼
  - 1:1000-1:5000濃度對離體蛙心灌流時，可使心率減慢，房室傳導完全阻滯或週期性阻滯;
  - 對乙醚麻醉貓靜脈注射10 mg/kg，可引起血壓下降。
- 浙貝母中所含脂肪酸有抑制**血管緊張素轉化酶(Angiotesin Converting Enzyme)**的作用。

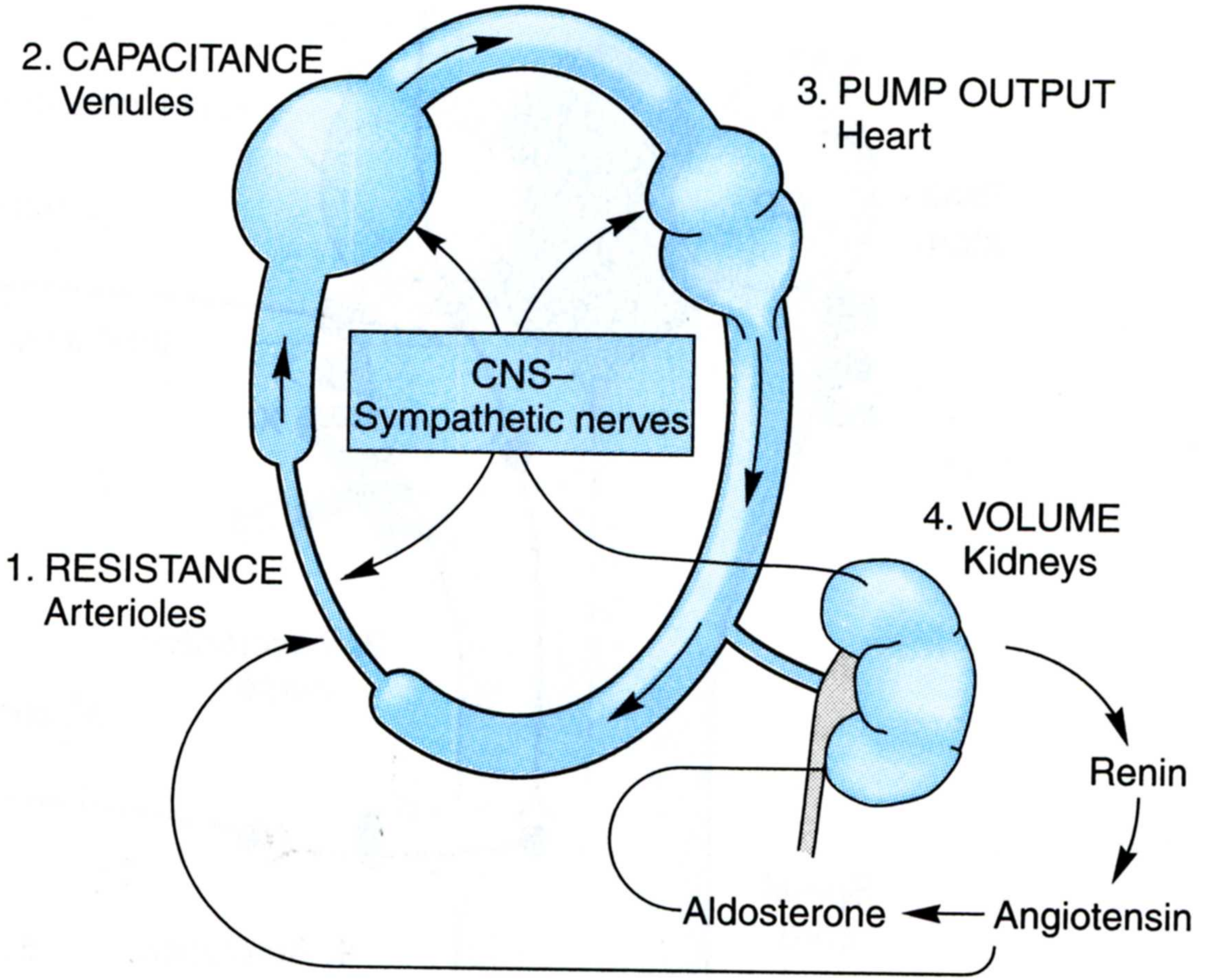


Figure 11–1. Anatomic sites of blood pressure control.

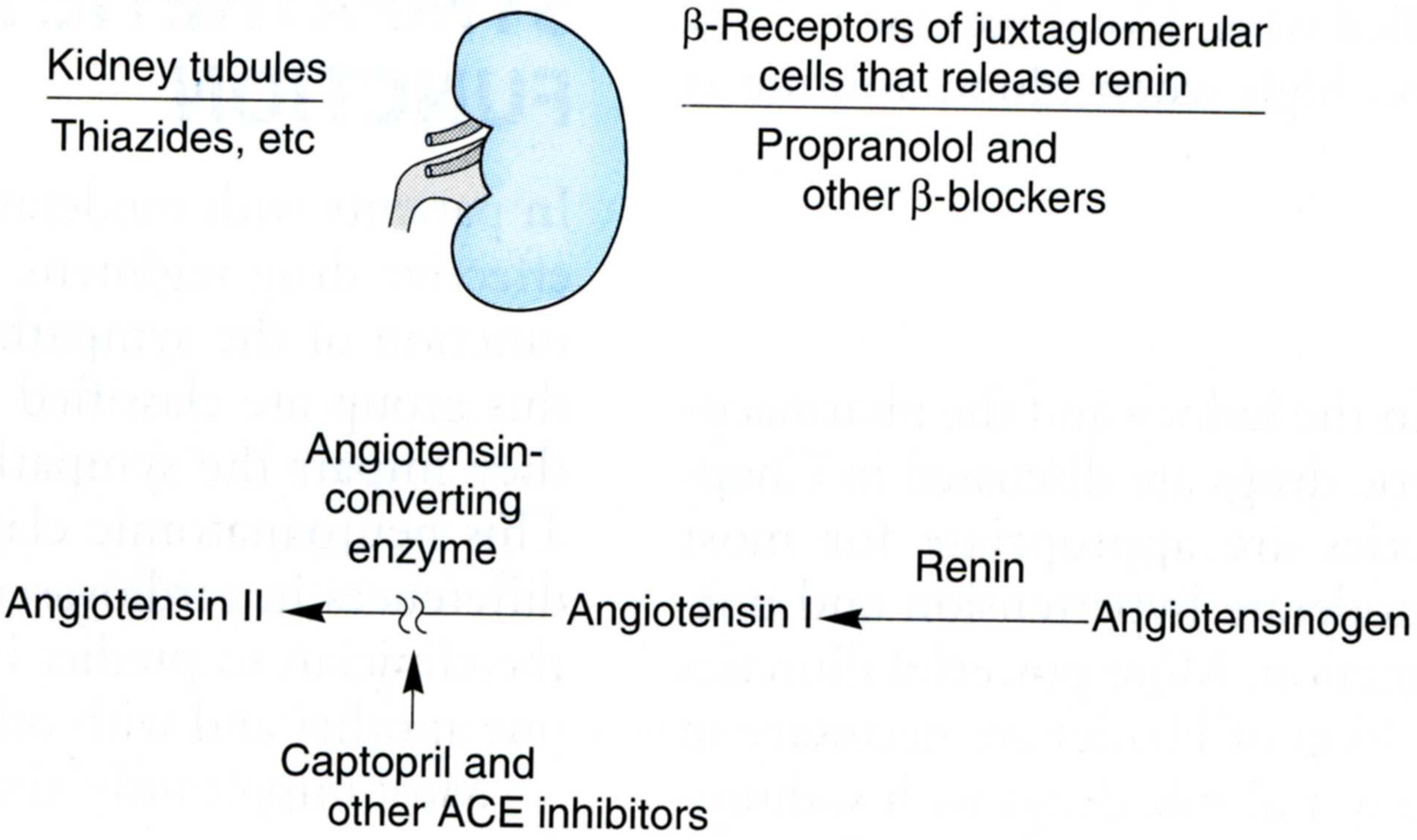


Figure 11–3. Sites of action of the major classes of antihypertensive drugs.

- 1%浙貝母鹼：
  - 滴眼能使兔、貓、犬瞳孔擴大;
  - 犬靜脈注射0.6~3 mg/kg可使涎液分泌明顯抑制，但作用短暫，5分鐘後即恢復。
- 兔靜脈注射浙貝母鹼可使血糖中度升高。

綜述

- 與浙貝母清熱化痰，降氣止咳，散結消腫之功效相關的藥理作用：
  - 鎮咳、祛痰、平喘、抗發炎。
- 主要成分：浙貝母中的生物鹼。
- 現代研究：浙貝母及浙貝母生物鹼對中樞神經、平滑肌、心血管的作用。

現代應用

1. 急性呼吸道感染：浙貝母對急性氣管炎、肺炎引起的咳嗽多痰、痰稠色黃、口乾喉痒有明顯療效。
2. 乳腺增生：浙貝母配青皮、昆布、乳香、夏枯草。

不良反應

- 豚鼠皮下注射浙貝母鹼和去氫浙貝母鹼4mg/kg，可使少數豚鼠出現四肢顫動，6mg/kg出現驚厥死亡。
- 浙貝母鹼靜脈注射最小死致量：
  - 兔：10 mg/kg;
  - 貓：8~10 mg/kg,
- 靜脈注射後15分鐘出現瞳孔擴大、四肢無力，60分鐘後出現震顫、驚厥、呼吸困難、死亡。
- 小鼠靜脈注射浙貝母鹼和去氫浙貝母鹼最小致死量為9 mg/kg。

苦杏仁

- 薔薇科植物：
  - 山杏*Prunus ameniaca* L. *var. ansu* Maxim.、
  - 西伯利亞杏*Prunus sibirica* L.、
  - 東北杏*Prunus mandshuhca*(Maxim.) Koehne
  - 杏*Prunus ameniaca* L.

  的乾燥成熟種子。

苦杏仁

- 主要成分：
  - 脂肪油約50%，
  - 苦杏仁苷 (Amygdalin)約3%，
  - 蛋白質
  - 多種游離氨基酸。
  - 苦杏仁苷酶 (amygdalase)、
  - 苦杏仁酶 (Emulsin)
  - 櫻苷酶 (Prunase)。
- 味苦，性微溫，有小毒。歸肺、大腸經。

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：降氣止咳平喘，潤腸通便。
- 主治：咳嗽氣喘，胸滿痰多，血虛津枯，腸燥便秘。
- 滇南本草：止咳嗽，消痰潤肺，潤腸胃。
- 珍珠囊：除肺熱，治上焦風燥，利胸膈氣逆，潤大腸氣秘。

祛痰、鎮咳、平喘

- 苦杏仁炮製品0.8 g/kg給豚鼠灌胃，有顯著的鎮咳及平喘作用。
- 苦杏仁0.4 g/kg、0.8 g/kg給小鼠灌胃，有顯著的祛痰作用。
- 苦杏仁中所含的**苦杏仁苷**，經腸道微生物或杏仁本身所含苦杏仁酶的分解產生微量的**氫氰酸**，對呼吸中樞呈抑制作用，可能與其鎮咳、平喘效應有關。

抗發炎

- 苦杏仁的胃蛋白酶水解產物：
  - 對大鼠棉球肉芽腫有抑制作用，
  - 不抑制角叉菜膠引起的大鼠足爪急性腫脹，
  - 對佐劑所致大鼠關節炎的I期和II期損傷的發展也無抑制作用，
  - 對佐劑引起的關節炎鼠，能延長優球蛋白溶解時間，並抑制結締組織的增殖。
- 從杏仁中提得的蛋白質成分KR-A和KR-B有明顯的抗發炎作用：
  - KR-A和KR-B給大鼠灌胃，抗角叉菜膠性足距腫脹的ED_{50}分別為13.9 mg/kg和6.4 mg/kg。

對免疫功能的作用

- 苦杏仁苷：
  - 小鼠肌肉注射，明顯促進有絲分裂原對脾臟T淋巴細胞的增殖和增強小鼠脾臟NK細胞的活性。
  - 3mg/日肌肉注射，對小鼠肝枯否氏細胞（kupffer cell）吞噬功能有非常明顯的促進作用。

潤腸通便

- 苦杏仁含豐富的脂肪油，能起潤腸通便的作用。

其他藥理作用

對消化系統的作用

- 苦杏仁苷：
  - 在酶的作用下分解形成氫氰酸及苯甲醛。
    - 苯甲醛在體外及在健康者或潰瘍病者體內，均能抑制胃蛋白酶的消化功能。
- 杏仁水溶性部分的胃蛋白酶水解產物500 mg/kg：
  - 對四氯化碳處理的大鼠給藥，能抑制AST、ALT活性和羥脯氨酸含量的升高和肝結締組織的增生，
  - 不能抑制D-半乳糖胺引起的鼠AST、ALT活性升高。
- 苦杏仁苷200 mg/kg皮下注射，對小鼠肝細胞增生有明顯的促進作用。

鎮痛

- 杏仁的胃蛋白酶水解產物對乙酸引起的小鼠扭體反應有抑制作用。
- 苦杏仁苷皮下注射100~800 mg/kg，小鼠熱板法和醋酸扭體法證實有鎮痛作用，且無耐受性和無豎尾反應及nalorphine（納絡芬）誘發的跳躍反應。
- KR-A和KR-B靜脈注射能抑制小鼠扭體反應，具有鎮痛效應。

抗腫瘤作用

- 苦杏仁熱水提取物：
  - 體外實驗對人子宮頸癌JTC-26株的抑制率為50~70%。
- 氫氰酸、苯甲醛、苦杏仁苷體外實驗：
  - 均有微弱的抗癌作用，
  - 用氫氰酸加苯甲醛或苦杏仁苷加β-葡萄糖苷酶可明顯提升抗癌效力。
    - 大鼠接種W265癌肉瘤5天後，用苦杏仁苷進行治療，對照組平均生存期為23天，苦杏仁苷組為33天，苦杏仁苷加β-葡萄糖苷酶組為41天。
- 小鼠自由攝食苦杏仁：
  - 抑制艾氏腹水癌的生長，
  - 使小鼠生存期延長。

- 苦杏仁苷：
  - 能防治二甲基亞硝胺誘導的肝癌，可使腫瘤病灶縮小。
  - 抗突變作用，減少由metamizole sodium、Mitomycin C引起的微核多染性紅細胞數;
  - 提升大鼠腦缺血狀態下細胞色素氧化酶的活性作用。

綜述

- 與苦杏仁止咳平喘、潤腸通便功效相關的藥理作用：
  - 祛痰、鎮咳、平喘、抗發炎、免疫促進，及潤腸通便作用。
- 主要有效成分：苦杏仁苷、蛋白酶水解產物及脂肪油。
- 還具有鎮痛、抗腫瘤作用，對消化系統功能也有一定影響。

現代應用

- 慢性氣管炎：取帶皮苦杏仁與量冰糖研碎混合，製成杏仁糖，早晚各服9g,10天為一療程。對咳、痰、喘都有治療作用。
- 急慢性呼吸道感染：取光杏仁、生半夏為末，製成糊狀藥，外敷兩足涌泉穴，早晚各更，對急性上呼吸道感染、急慢性氣管炎有一定效果。
- 外陰騷癢：杏仁研成細粉，加麻油調成糊狀塗擦，每日1次，或用帶線棉球蘸杏仁油糊塞入陰道，24小時後取出。

不良反應

- 本品含苦杏仁苷，可分解產生氫氰酸而抑制細胞色素氧化酶，使細胞氧化反應停止，人若過量服用 (兒童10-20粒，成人40-60粒)，會引起組織窒息。
- 苦杏仁苷：
  - 口服易在胃腸道分解出氫氰酸，毒性比靜脈注射大。
  - 中毒症狀：眩暈、頭痛、呼吸急促、噁心、嘔吐、紫疳、昏迷、驚厥，搶救不當可致死亡。
  - 每日口服0.6~1.2 g ，可避免毒性反應。
  - 小鼠、大鼠靜脈注射LD_{50}為25g/kg，腹腔注射為8g/kg。